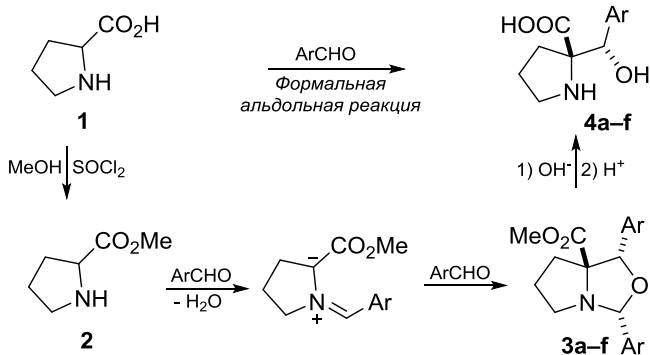


НОВАЯ ДИАСТЕРЕОСЕЛЕКТИВНАЯ α -ФУНКЦИОНАЛИЗАЦИЯ ПРОЛИНА БЕНЗАЛЬДЕГИДАМИ

Павлушин А.В., Мошкин В.С., Сосновских В.Я.

Уральский федеральный университет
620002, г. Екатеринбург, ул. Мира, д. 19

В нашей работе мы использовали 2-оксапирролизидины **3**, образующиеся при взаимодействии метилпролина **2** с двумя молекулами ароматического альдегида, как ценные интермедиаты для получения α -замещенных пролинов **4**. Найдены условия для их последовательного гидролиза, раскрытия оксазолидинового цикла и выделения образующихся при этом α -(α -гидроксибензил)пролинов преимущественно в виде одного диастереомера (5 стадий исходя из пролина, общий выход 33–50%, содержание второго диастереомера 0–9%).



Выходы α -(α -гидроксибензил)пролинов **5a–f**:

- a** Ar = Ph, 45%
- b** Ar = 4-MeC₆H₄, 48%
- c** Ar = 4-ClC₆H₄, 44%
- d** Ar = 4-BrC₆H₄, 44%
- e** Ar = 4-MeOC₆H₄, 50%
- f** Ar = 3,4-(MeO)₂C₆H₃, 33%

Описанная последовательность введения α -гидроксибензильного заместителя в α -положение пролина **1** представляет собой диастереоселективную альдольную функционализацию пролина ароматическими альдегидами и делает доступными целый ряд новых α -замещенных пролинов, интересных с точки зрения их потенциальной биологической активности и возможности дальнейших синтезов на их основе.

Работа выполнена при финансовой поддержке гранта РНФ (грант № 14-13-00388).